

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
14 décembre 2000 (14.12.2000)

PCT

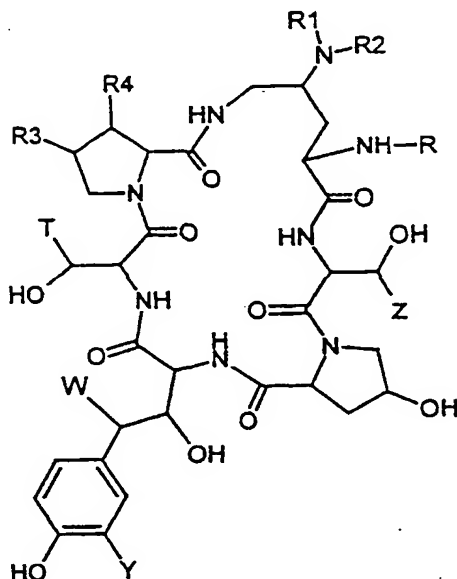
(10) Numéro de publication internationale
WO 00/75177 A1

- (51) Classification internationale des brevets⁷: C07K 7/56, A61K 38/12, A61P 31/10
- (21) Numéro de la demande internationale: PCT/FR00/01568
- (22) Date de dépôt international: 8 juin 2000 (08.06.2000)
- (25) Langue de dépôt: français
- (26) Langue de publication: français
- (30) Données relatives à la priorité:
99/07251 9 juin 1999 (09.06.1999) FR
- (71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US):
HOECHST MARION ROUSSEL [FR/FR]; 1, terrasse
Bellini, F-92800 Puteaux (FR).
- (72) Inventeurs; et
(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement): FAU-
VEAU, Patrick [FR/FR]; 40, avenue Camille Desmoulins,
F-93190 Livry Gargan (FR). HAWSER, Stephen [GB/IT];
Via Casa Zamboni, 54, I-37020 Arbizzano di Valpolicella
(IT). LEBOURG, Gilles [FR/FR]; 43, rue de Maison
Rouge, F-93220 Gagny (FR). SCHIO, Laurent [FR/FR];
24, allée Charles Magne, F-93140 Bondy (FR).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: ECHINOCANDIN DERIVATIVES, METHOD FOR PREPARING SAME AND APPLICATION AS ANTIFUNGAL AGENTS

(54) Titre: NOUVEAUX DERIVES DE L'ECHINOCANDINE, LEUR PROCEDE DE PREPARATION ET LEUR APPLICATION COMME ANTIFONGIQUES



(57) Abstract: The invention concerns in all possible isomeric forms as well as their mixtures, compounds of formula (I) wherein: either R₁ represents H or CH₃ and R₂ represents cyclohexyl substituted by an amine, a (CH₂)_b-C≡N radical; or R₁ and R₂ form with the nitrogen which bears them a cycle with 3, 4 or 5 carbons optionally substituted by an amine; R₃ represents hydrogen, methyl of hydroxyl; R₄ represents hydrogen or hydroxyl; R represents a linear, branched or cyclic chain; T represents hydrogen, methyl, CH₂CONH₂,

[Suite sur la page suivante]

1001807-12201

WO 00/75177 A1



(74) Mandataire: TONNELIER, Marie-José; Hoechst Marion Roussel, 102, route de Noisy, F-93235 Ro-mainville Cedex (FR).

MC, NL, PT, SE), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(81) États désignés (*national*): AE, AG, AL, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, DZ, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KP, KR, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MG, MK, MN, MX, MZ, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, TR, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ZA.

Publiée:

- Avec rapport de recherche internationale.
- Avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues.

(84) États désignés (*régional*): brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

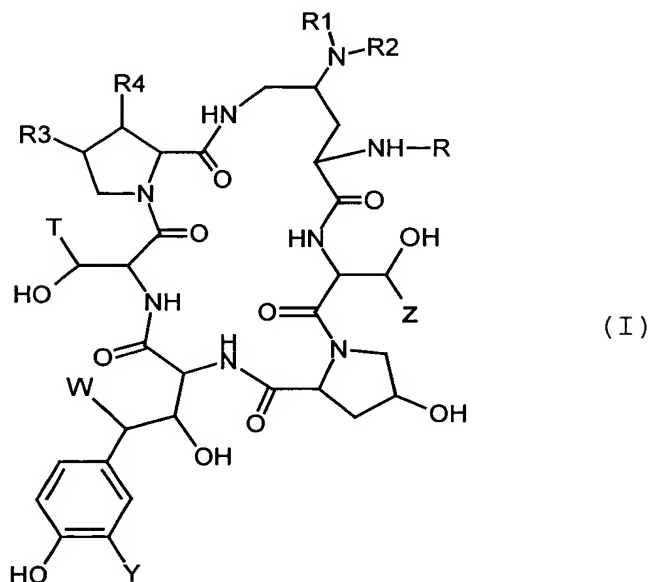
10013073-132101

$\text{CH}_2\text{C}=\text{N}$, a $(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$ or $(\text{CH}_2)_2\text{Nalk}^+\text{X}^-$ radical, X being halogen and alk an alkyl radical; Y represents hydrogen, hydroxyl, halogen or OSO_3H ; W represents H or OH; Z represents H, CH_3 . The compounds of formula (I) have antifungal properties.

(57) Abrégé: L'invention a pour objet sous toutes les formes d'isomères possibles ainsi que leurs mélanges, les composés de formule (I) dans lesquels ou bien R_1 : H ou CH_3 et R_2 cyclohexyle substitué par une amine, un radical $(\text{CH}_2)_b\text{C}=\text{N}$ ou bien R_1 et R_2 forment avec l'azote qui les porte un cycle à 3, 4 ou 5 carbones éventuellement substitué par une amine, R_3 hydrogène, méthyle ou hydroxyle, R_4 hydrogène ou hydroxyle, R représente une chaîne linéaire, ramifiée ou cyclique, T hydrogène, méthyle, CH_2CONH_2 , $\text{CH}_2\text{C}=\text{N}$, un radical $(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$ ou $(\text{CH}_2)_2\text{Nalc}^+\text{X}^-$, X halogène et alc alkyle, Y hydrogène, hydroxyle, halogène ou OSO_3H , W H ou OH, Z H, CH_3 . Les composés de formule (I) présentent des propriétés antifongiques.

ABSTRACT

A subject of the invention, in all possible isomer forms as well as their mixtures, is the compounds of formula (I):



in which

either R_1 : H or CH_3 and

R_2 : cyclohexyl substituted by an amine, a $(CH_2)_b-C\equiv N$ radical or R_1 and R_2 together with the nitrogen which carries them form a ring with 3, 4 or 5 carbons optionally substituted by an amine

R_3 : hydrogen, methyl or hydroxyl

R_4 : hydrogen or hydroxyl

R : represents a linear, branched or cyclic chain

T : hydrogen, methyl, CH_2CONH_2 , $CH_2C\equiv N$, a $(CH_2)_2NH_2$ or $(CH_2)_2Nalk^+X^-$ radical, X halogen and alk alkyl

Y : hydrogen, hydroxyl, halogen or OSO_3H ,

W : H or OH,

Z : H, CH_3 .

The compounds of formula (I) have antifungal properties.

10018073.122104